

**Translation**

**PATENT COOPERATION TREATY**

PCT/JP2003/015821



**PCT**

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY**  
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference <b>B020534</b>	<b>FOR FURTHER ACTION</b>		See Form PCT/IPEA/416
International application No. <b>PCT/JP2003/015821</b>	International filing date ( <i>day/month/year</i> ) <b>10 December 2003 (10.12.2003)</b>	Priority date ( <i>day/month/year</i> ) <b>27 December 2002 (27.12.2002)</b>	
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC <b>C07D 407/06, 317/60, 305/12</b>			
Applicant <b>KANEKA CORPORATION</b>			

1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.

2. This REPORT consists of a total of 4 sheets, including this cover sheet.

3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:

a. ☐ (*sent to the applicant and to the International Bureau*) a total of \_\_\_\_\_ sheets, as follows:

☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).

☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.

b. ☐ (*sent to the International Bureau only*) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) \_\_\_\_\_, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).

4. This report contains indications relating to the following items:

☒ Box No. I Basis of the report

☐ Box No. II Priority

☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

☐ Box No. IV Lack of unity of invention

☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

☒ Box No. VI Certain documents cited

☐ Box No. VII Certain defects in the international application

☐ Box No. VIII Certain observations on the international application

Date of submission of the demand <b>20 July 2004 (20.07.2004)</b>	Date of completion of this report <b>12 November 2004 (12.11.2004)</b>
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

# INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/015810

## Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

☐ This report is based on translations from the original language into the following language \_\_\_\_\_, which is language of a translation furnished for the purpose of:

- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
- ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
- ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

☒ The international application as originally filed/furnished

☐ the description:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☐ the claims:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement) under Article 19

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☐ the drawings:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☒ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

☐ the description, pages \_\_\_\_\_

☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_

☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_

☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

☐ the description, pages \_\_\_\_\_

☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_

☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_

☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

## Box No. IV Lack of unity of invention

1. ☐ In response to the invitation to restrict or pay additional fees the applicant has:
- ☐ restricted the claims.
  - ☐ paid additional fees.
  - ☐ paid additional fees under protest.
  - ☒ neither restricted nor paid additional fees.
2. ☐ This Authority found that the requirement of unity of invention is not complied with and chose, according to Rule 68.1, not to invite the applicant to restrict or pay additional fees.
3. This Authority considers that the requirement of unity of invention in accordance with Rules 13.1, 13.2 and 13.3 is
- ☐ complied with.
  - ☒ not complied with for the following reasons:

The inventions of claims 1-12 can be divided into two groups of inventions, i.e., a group of inventions concerning a method for identifying hepatitis B drug resistance by detecting gene mutations in the core promoter region of the hepatitis B virus (claims 1-11) and a group of inventions concerning a drug for the treatment of hepatitis B using nucleic acids of the hepatitis B virus core promoter region (claim 12).

Therefore, this examination finds that the inventions of claims 1-12 comprise the above two groups of inventions, and do not constitute one group of inventions so linked as to form a single general inventive concept.

4. Consequently, this report has been established in respect of the following parts of the international application:

- ☐ all parts.
- ☒ the parts relating to claims Nos. 1-11.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP03/15810

**Box No. V** Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)

Claims	1-11	YES
Claims		NO

Inventive step (IS)

Claims	2-9	YES
Claims	1, 10-11	NO

Industrial applicability (IA)

Claims	1-11	YES
Claims		NO

## 2. Citations and explanations (Rule 70.7)

Document 1: J. Gastroenterol. Hepatol., 2001, Vol. 16, No. 4, pages 393-8

## •Claims 1, 10 and 11

Based on the description in document 1 cited in the international search report, the inventions of claims 1, 10 and 11 lack an inventive step.

Document 1 states that when there is a genetic mutation in the core promoter region of the hepatitis B virus, its sensitivity to interferons increases.

With respect to claims 1, 10 and 11, this examination finds that after referring to the description in document 1, persons skilled in the art can easily identify drug resistance by checking for genetic mutations in the core promoter region of the hepatitis B virus and can use DNA from the hepatitis B virus core promoter region as a drug for the treatment of hepatitis B.

## •Claims 2-9

Document 1 cited in the international search report does not describe the inventions of claims 2-9, and therefore these inventions are novel and involve an inventive step.

Document 1 does not describe the identification of lamivudine resistance by checking for genetic mutations in the core promoter region of the hepatitis B virus, and persons skilled in the art cannot easily conceive of this matter.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP03/15810

## Supplemental Box Relating to Sequence Listing

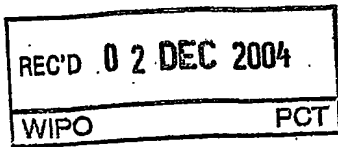
## Continuation of Box No. 1, Item 2:

1. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application and necessary to the claimed invention, this report was established on the basis that of:
- a. type of material
    - ☒ a sequence listing
    - ☐ table(s) related to the sequence listing
  - b. format of material
    - ☐ in written format
    - ☒ in computer readable form
  - c. time of filing/furnishing
    - ☐ contained in the international application as filed
    - ☒ filed together with the international application in computer readable form
    - ☐ furnished subsequently to this Authority for the purpose of search and/or examination
    - ☐ received by this Authority as an amendment\* on \_\_\_\_\_
2. ☒ In addition, in the case that more than one version or copy of a sequence listing and/or table(s) relating thereto has been filed or furnished, the required statements that the information in the subsequent or additional copies is identical to that in the application as filed or does not go beyond the application as filed, as appropriate, were furnished.
3. Additional comments:

\* If item 4 in Box No. 1 applies, the listing and /or table(s) related thereto, which form part of the basis of the report, may be marked "superseded".

特 許 協 力 条 約

PCT



特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条)  
[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 B 0 2 0 5 3 4		今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/15821	国際出願日 (日.月.年) 10.12.2003	優先日 (日.月.年) 27.12.2002	
国際特許分類 (IPC) Int. Cl <sup>7</sup> C07D407/06, 317/60, 305/12			
出願人 (氏名又は名称) 鐘 淵 化 学 工 業 株 式 会 社			

<p>1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。</p> <p>2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 4 ページからなる。</p> <p>3. この報告には次の附属物件も添付されている。</p> <p>a <input type="checkbox"/> 附属書類は全部で _____ ページである。</p> <p><input type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)</p> <p><input type="checkbox"/> 第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとの国際予備審査機関が認定した差替え用紙</p> <p>b <input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)</p>	
<p>4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第I欄 国際予備審査報告の基礎</p> <p><input type="checkbox"/> 第II欄 優先権</p> <p><input type="checkbox"/> 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成</p> <p><input type="checkbox"/> 第IV欄 発明の単一性の欠如</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第VI欄 ある種の引用文献</p> <p><input type="checkbox"/> 第VII欄 国際出願の不備</p> <p><input type="checkbox"/> 第VIII欄 国際出願に対する意見</p>	

国際予備審査の請求書を受理した日 20.07.2004	国際予備審査報告を作成した日 12.11.2004		
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 荒 木 英 則	4 C	9 7 3 6
電話番号 03-3581-1101 内線 3450			

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

## 第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、\_\_\_\_\_ 語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査

☐ PCT規則12.4にいう国際公開

☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 \_\_\_\_\_ ページ、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 \_\_\_\_\_ 項、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ

☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項

☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ

☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項

☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

## 第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性(N)	請求の範囲	1-22, 24, 25	有
	請求の範囲	23, 26-33	無
進歩性(IS)	請求の範囲	1-22, 24, 25	有
	請求の範囲	23, 26-33	無
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲	1-33	有
	請求の範囲		無

## 2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

見解は、国際調査報告で引用された以下の各文献の記載に基づいて示される。

文献1: FR 2772027 A(FOURNIER INDUSTRIE ET SANTE S.A.)

文献2: EP 906901 A2(AJIMNOMOTO CO., INC.)

文献3: WO 98/05634 A1(KANEKA CORP.)

文献4: WO 97/37665 A1(BANYU PHARM. CO., LTD.)

文献5: WO 95/05374 A1(BANYU PHARM. CO., LTD.)

文献6: EP 309766 A2(BANYU PHARM. CO., LTD.)

文献7: Bioorg. Med. Chem., 2002, 10(8), pp. 2553-2560

○請求の範囲23, 26-33について

文献1から7の明細書(特に実施例)には、本願の式(10)、(11)又は(12)で表される化合物が記載されている。

してみれば、請求の範囲23, 26-33に係る発明は、文献1から7の記載により新規性又は進歩性を有さない。

○請求の範囲1-22, 24, 25について

本願の請求の範囲1-22, 24, 25に係る発明と文献1から7に係る発明を比較すると、前者はラクトン誘導体及びその製造中間体とそれらの製造方法について具体的に記載されている点で後者に相違する。そして、この点について記載された文献はないため、これらの文献の記載によっては当業者といえども容易に請求の範囲1-22, 24, 25に係る発明に想到し得たものとは認められない。

したがって、請求の範囲1-22, 24, 25に係る発明は、文献1から7の記載によっても進歩性を有するものである。



## 第VI欄 ある種の引用文献

## 1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
JP 2003-295 「EX」	07. 01. 2003	29. 06. 2001	19. 04. 2001

## 2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--